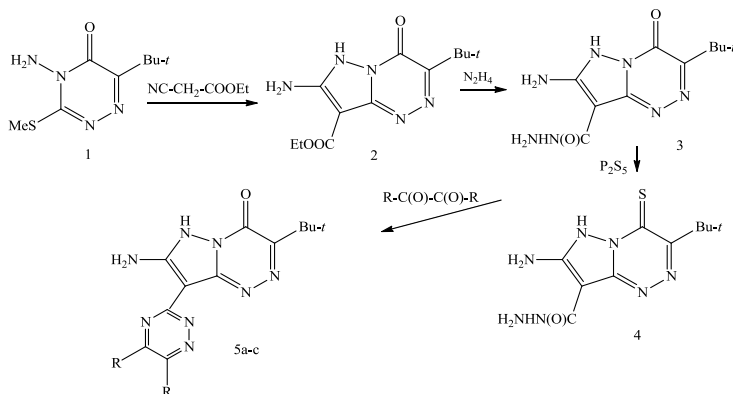


ХИМИЧЕСКИЕ ПРЕВРАЩЕНИЯ В РЯДУ ПРОИЗВОДНЫХ ПИРАЗОЛО[5,1-с][1,2,4]ТРИАЗИНОВ

Ларина С.Э., Миронович Л.М.

Юго-Западный государственный университет
305040, г. Курск, ул. 50 лет Октября, д. 94

Ранее нами получена этил 7-амино-3-*трет*-бутил-5-оксо-6*H*-пиразоло[5,1-с][1,2,4]-триазин-8-карбоновая кислота (**1**) кипячением 4-амино-6-*трет*-бутил-3-метилсульфанил-1,2,4-триазин-5(4*H*)-она с цианукусным эфиром в среде пиридина [1].



Кипячение соединения **1** с гидразингидратом в среде 2-пропанола привело к нуклеофильному замещению этоксигруппы на гидразиновую с выделением 7-амино-3-*трет*-бутил-5-оксо-6*H*-пиразоло[5,1-с][1,2,4]-триазин-8-карбгидразида (**2**). Замещение оксогруппы на тиоксогруппу проводили кипячением соединения **1** в среде пиридина с пентасульфидом фосфора и выделили 7-амино-3-*трет*-бутил-5-тиоксо-6*H*-пиразоло[5,1-с][1,2,4]-триазин-8-карбгидразид (**3**). В ИК спектре соединения **3** появляется характеристическая полоса поглощения тионной группы при 1205 см^{-1} , отсутствующая в ИК спектре соединения **2**. Исчезает полоса поглощения при 1641 см^{-1} , отнесенная к валентным колебаниям группы $\text{C}^4=\text{O}$ соединения **2** и сохраняются полосы поглощения при 1660 (**2**) и 1720 см^{-1} (**3**), соответствующие валентным колебаниям группы $-\text{C}(\text{O})-$ заместителя в положении 8 гетероцикла. 4.15 (м, 3H, NHNH_2)

Взаимодействием 7-амино-3-*трет*-бутил-5-оксо-6*H*-пиразоло[5,1-с][1,2,4]-триазин-8-карбгидразида с α -дикетонами выделили 7-амино-3-*трет*-бутил-8-[5*R*,6*R*-1,2,4-триазирил-3]-1,4-дигидропиразоло[5,1-с][1,2,4]триазин-4-оны (**5a-c**). Реакцию проводили

при кипячении в среде ледяной уксусной кислоты в присутствии ацетата аммония. Проводили хроматографический контроль прохождения реакции. В спектре ЯМР ^1H протоны фурановых циклов находятся при 7.09 (д, 1H, C₄-H_{фуран}); 7.93 (д, 1H, C₂-H_{фуран}); 8.09 (д, 1H, C₅-H_{фуран}) (**5c**). Масс-спектр соединения **5c** подтверждает его структуру: 418 (14.9) [M⁺].

1. Миронович Л.М., Костина М.В. // Химия гетероциклических соединений. 2011. № 10. С. 1555–1559.

СИНТЕЗ N-ЗАМЕЩЕННЫХ 1,2,3,4-ТЕТРАГИДРОПИРИМИДИН-2-ТИОНОВ

Лапманова Е.А., Ширяев А.К.

Самарский государственный технический университет
443100, г. Самара, ул. Молодогвардейская, д. 244

Фрагмент пиримидина входит в состав структур природных и биологически активных веществ. Производные тетрагидропиримидина проявляют антибактериальную, противовоспалительную и противопаркинсоническую активность. Они также являются блокаторами кальциевых каналов и действуют как антагонисты нейропептидов, в связи с чем обусловлен значительный интерес к их синтезу в последние годы. Целью работы является селективная функционализация тетрагидропиримидинов путем защиты одного атома азота тетрагидропиримидинового кольца.

Для селективного алкилирования 1,2,3,4-тетрагидропиримидин-2-тиона по атому серы нами были проведены реакции тетрагидропиримидин-2-тиона **1** с тозилхлоридом и хлорангидридом *n*-нитробензойной кислоты. В результате реакций были получены производные тетрагидропиримидин-2-тиона **2a** и **2b**. Реакцию проводили при нагревании в пиридине в течение четырех часов. Направление реакции ацилирования по атому N3, вероятно, определяется экранированием атома N1 соседней метильной группой.